PCT

WELTORGANISATION FÜR GEISTIGES EIGENTUM Internationales Büro

INTERNATIONALE ANMELDUNG VERÖFFENTLICHT NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT)

(51) Internationale Patentklassifikation 6:

C07D 495/04, A61K 31/505 // (C07D 495/04, 333:00, 239:00)

A1

DE

(11) Internationale Veröffentlichungsnummer: WO 98/06722

(43) Internationales Veröffentlichungsdatum:

19. Februar 1998 (19.02.98)

(21) Internationales Aktenzeichen:

PCT/EP97/04139

(22) Internationales Anmeldedatum:

64293 Darmstadt (DE).

30. Juli 1997 (30.07.97)

(30) Prioritätsdaten:

196 32 423.8

12. August 1996 (12.08.96)

(81) Bestimmungsstaaten: AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CU, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, GB, GE, GH, HU, IL, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, TJ, TM, TR, TT, UA, UG, US, UZ, VN, YU, europäisches Patent (AT, BE, CH, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE).

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten ausser US): MERCK PATENT GMBH [DE/DE]; Frankfurter Strasse 250, D-

(72) Erfinder; und
(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): ROCHUS, Jonas [DE/DE];
Stormstrasse 7, D-64291 Darmstadt (DE). SCHELLING,
Pierre [DE/DE]; Bardenbergweg 17, D-64367 Mühltal (DE).
KLUXEN, Franz-Werner [DE/DE]; Bessunger Strasse 3, D-64285 Darmstadt (DE). CHRISTADLER, Maria [DE/DE];
Dürerstrasse 10, D-63322 Rödermark (DE).

(74) Gemeinsamer Vertreter: MERCK PATENT GMBH; Frankfurter Strasse 250, D-64293 Darmstadt (DE).

Veröffentlicht

Mit internationalem Recherchenbericht.

Vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche zugelassenen Frist. Veröffentlichung wird wiederholt falls Änderungen eintreffen.

(54) Title: THIENOPYRIMIDINES

(54) Bezeichnung: THIENOPYRIMIDINE

(57) Abstract

Thienopyrimidines of formula (I) and their physiologically harmless salts, in which R¹, R², R³, R⁴, X and n have the meaning indicated in claim 1, present a phosphodiesterase V-Inhibition activity and can be used in the treatment of cardio-vascular disorders and in impotence therapy.

(57) Zusammenfassung

Thienopyrimidine der Formel (I) sowie deren physiologisch unbedenklichen Salze, worin R¹, R², R³, R⁴, X und n die in Anspruch

1 angegebenen Bedeutungen haben, zeigen eine Phosphodiesterase V-Hemmung und können zur Behandlung von Erkrankungen des Herz-Kreislaufsystems und zur Therapie von Potenzstörungen eingesetzt werden.

LEDIGLICH ZUR INFORMATION

Codes zur Identifizierung von PCT-Vertragsstaaten auf den Kopfbögen der Schriften, die internationale Anmeldungen gemäss dem PCT veröffentlichen.

AL	Albanien	ES	Spanien	LS	Lesotho	SI	Slowenien
AM	Armenien	FI	Finnland	LT	Litauen	SK	Słowakci
AT	Osterreich	FR	Frankreich	LU	Luxemburg	SN	Senegal
AU	Australien	GA	Gabun	LV	Lettland	SZ	Swasiland
AZ	Aserbaidschan	GB	Vereinigtes Königreich	MC	Monaco	TD	Tschad
BA	Bosnien-Herzegowina	GE	Georgien	MD	Republik Moldau	TG	Togo
BB	Barbados	GH	Ghana	MG	Madagaskar	TJ	Tadschikisten
BE	Belgien	GN	Guinea	MK	Die ehemalige jugoslawische	TM	Turkmenistan
BF	Burkina Faso	GR	Griechenland		Republik Mazedonien	TR	Türkei
BG	Bulgarien	HU	Ungaro	ML	Mali	TT	Trinidad und Tobago
BJ	Benin	(E	Irland	MN	Mongolei	UA	Ukraine
BR	Brasilien	IL	[arne]	MR	Mauretanien	UG	Uganda
BY	Relatus	is	Island	MW	Malawi	US	Vereinigte Staaten von
CA	Kanada	IT	Italien	MX	Mexiko		Amerika
CF	Zentralafrikanische Republik	JP	Japan	NE	Niger	UZ	Usbekistan
CG	Kongo	KE	Kenia	NL	Niederlande	VN	Vietnam
CH	Schweiz	KG	Kirgisistan	NO	Norwegen	YU	Jugoslawien
CI	Côte d'Ivoire	KP	Demokratische Volksrepublik	NZ	Neusceland	zw	Zimbabwe
CM	Kamerun	•••	Korea	PL	Polen		
CN	China	KR	Republik Korea	Pľ	Portugal		
CU	Kuba	KZ	Kasachatan	RO	Rumlnien		
CZ	Tschechische Republik	ic	St. Lucia	RU	Russische Föderation		
DE	Deutschland	ü	Liechtenstein	SD	Sudan		
DK	Dinemark	LK	Sri Lanka	SE	Schweden		
EB	Estland	LR	Liberia	SG	Singapur		

Thienopyrimidine

Die Erfindung betrifft Verbindungen der Formel I

PCT/EP97/04139 WO 98/06722

und

n

0, 1, 2 oder 3

5

bedeuten,

sowie deren physiologisch unbedenklichen Salze.

10 Pyrimidinderivate sind beispielsweise aus der EP 201 188 oder der WO 93/06104 bekannt.

Der Erfindung lag die Aufgabe zugrunde, neue Verbindungen mit wertvollen Eigenschaften aufzufinden, insbesondere solche, die zur Herstellung von Arzneimitteln verwendet werden können.

Es wurde gefunden, daß die Verbindungen der Formel I und ihre Salze bei guter Verträglichkeit sehr wertvolle pharmakologische Eigenschaften besitzen.

20

35

15

Insbesondere zeigen sie eine spezifische Inhibierung der cGMP-Phosphodiesterase (PDE V).

Chinazoline mit cGMP-Phosphodiesterase hemmender Aktivität sind z.B. in J. Med. Chem. 36, 3765 (1993) und ibid. 37, 2106 (1994) beschrieben. 25

Die biologische Aktivität der Verbindungen der Formel I kann nach Methoden bestimmt werden, wie sie z.B in der WO 93/06104 beschrieben sind.

30 Die Affinität der erfindungsgemäßen Verbindungen für cGMP- und cAMP-Phosphodiesterase wird durch die Ermittlung ihrer IC₅₀-Werte (Konzentration des Inhibitors, die benötigt wird, um eine 50 %ige Inhibierung der Enzymaktivität zu erreichen) bestimmt.

Zur Durchführung der Bestimmungen können nach bekannten Methoden isolierte Enzyme verwendet werden (z.B. W.J. Thompson et al., Biochem. 1971, 10, 311). Zur Durchführung der Versuche kann eine modifizierte

"batch"-Methode von W.J. Thompson und M.M. Appleman (Biochem. 1979, 18, 5228) angewendet werden.

Die Verbindungen eignen sich daher zur Behandlung von Erkrankungen des Herz-Kreislaufsystems, insbesondere der Herzinsuffizienz und zur Therapie von Potenzstörungen.

Die Verbindungen der Formel I können als Arzneimittelwirkstoffe in der Human- und Veterinärmedizin eingesetzt werden. Ferner können sie als Zwischenprodukte zur Herstellung weiterer Arzneimittelwirkstoffe eingesetzt werden.

Gegenstand der Erfindung sind dementsprechend die Verbindungen der Formel I sowie ein Verfahren zur Herstellung

a) von Verbindungen der Formel I nach Anspruch 1 sowie deren Salzen, worin X über N gebunden ist,

dadurch gekennzeichnet, daß man eine Verbindung der Formel II

20

25

10

15

$$R^{2}$$
 HN $(CH_{2})_{n}$ R^{4} \parallel R^{3}

worin

R¹, R², R³, R⁴ und n die angegebenen Bedeutungen haben,

und L CI, Br, OH, SCH₃ oder eine reaktionsfähige veresterte OH-Gruppe bedeutet,

mit einem unsubstituierten oder ein-, zwei- oder dreifach durch A, Hal oder CF₃ substituierten ungesättigten 5-7-gliedrigen Heterocyclus mit

mindestens einer NH-Gruppe, worin zusätzlich weitere CH₂-Gruppen durch NH, NA, S oder O ersetzt sein können,

umsetzt,

5

oder

b) von Verbindungen der Formel I nach Anspruch 1 sowie deren Salzen, worin X über C gebunden ist,

10

dadurch gekennzeichnet, daß man eine Verbindung der Formel III

15

20

$$R^1$$
 S
 N
 X

worin

R¹, R² und X die angegebenen Bedeutungen haben,

und L CI, Br, OH, SCH₃ oder eine reaktionsfähige veresterte OH-Gruppe bedeutet,

25 mit einer Verbindung der Formel IV

$$H_2N$$
 $(CH_2)_n$ R^3 IV

30

worin

R³, R⁴ und n die angegebenen Bedeutungen haben,

35

umsetzt,

oder

c) daß man in einer Verbindung der Formel I einen Rest R¹, R², R³ und/oder R⁴ in einen anderen Rest R¹, R², R³ und/oder R⁴ umwandelt, indem man eine Nitrogruppe reduziert, eine primäre oder eine sekundäre Aminogruppe durch reduktive Aminierung in ein alkyliertes Amin umwandelt oder acyliert,

und/oder daß man eine basische Verbindung der Formel I durch
10 Behandeln mit einer Säure in eines ihrer Salze überführt.

Vor- und nachstehend haben die Reste R¹, R², R³, R⁴, X, L und n die bei den Formeln I, II, III, IV und V angegebenen Bedeutungen, sofern nicht ausdrücklich etwas anderes angegeben ist.

15

5

A und A' bedeuten vorzugsweise jeweils unabhängig voneinander Alkyl mit 1-6 C-Atomen.

- In den vorstehenden Formeln ist Alkyl vorzugsweise unverzweigt und hat 1, 2, 3, 4, 5 oder 6 C-Atome, vorzugsweise 1, 2, 3, 4 oder 5 C-Atome und bedeutet vorzugsweise Methyl, Ethyl oder Propyl, weiterhin bevorzugt Isopropyl, Butyl, Isobutyl, sek.-Butyl oder tert.-Butyl, aber auch n-Pentyl, neo-Pentyl oder Isopentyl.
- Alkylen ist vorzugsweise unverzweigt und bedeutet bevorzugt Propylen, Butylen oder Pentylen.

Von den Resten R¹ und R² steht einer vorzugsweise für H, während der andere bevorzugt Propyl oder Butyl, besonders bevorzugt aber Ethyl oder Methyl bedeutet. Ferner bedeuten R¹ und R² auch zusammen bevorzugt Propylen, Butylen oder Pentylen.

Hal bedeutet vorzugsweise F, Cl oder Br, aber auch I.

Alkenyl steht vorzugsweise für Vinyl, 1- oder 2-Propenyl, 1-Butenyl, Isobutenyl, sek.-Butenyl, ferner bevorzugt ist 1-Pentenyl, iso-Pentenyl oder 1-Hexenyl.

Alkinyl steht vorzugsweise für Ethinyl, Propin-1-yl, ferner für Butin-1-, Butin-2-yl, Pentin-1-, Pentin-2- oder Pentin-3-yl.

Die Reste R³ und R⁴ können gleich oder verschieden sein und stehen vorzugsweise in der 3- oder 4-Position des Phenylrings. Sie bedeuten beispielsweise jeweils unabhängig voneinander H, Alkyl, Alkoxy, Nitro, Amino, Alkylamino wie z.B. Methylamino, Dialkylamino wie z.B. Dimethylamino, F, Cl, Br oder I oder zusammen Ethylenoxy, Methylendioxy oder Ethylendioxy. Bevorzugt stehen sie auch jeweils für Alkoxy, wie z.B. für Methoxy, Ethoxy oder Propoxy.

15

10

Der Rest X ist vorzugsweise unsubstituiertes oder ein-, zwei- oder dreifach durch Alkyl, Hal oder CF₃ substituiertes 2- oder 3-Furyl, 2- oder 3-Thienyl, 1-, 2- oder 3-Pyrrolyl, 1-, 2-, 4- oder 5-Imidazolyl, 2-Methyl-1-imidazol-1-yl, 1-, 3-, 4- oder 5-Pyrazolyl, 2-, 4- oder 5-Oxazolyl, 3-, 4- oder 5-Isoxazolyl, 2-, 4- oder 5-Thiazolyl, 3-, 4- oder 5-Isothiazolyl, 2-, 3- oder 4-Pyridyl, 2-, 4-, 5- oder 6-Pyrimidinyl, weiterhin bevorzugt 1,2,3-Triazol-1-, -4- oder -5-yl, 1,2,4-Triazol-1-, -3- oder 5-yl, 1- oder 5-Tetrazolyl, 1,2,3-Oxadiazol-4- oder -5-yl, 1,2,4-Oxadiazol-3- oder -5-yl, 1,3,4-Thiadiazol-2- oder -5-yl, 1,2,4-Thiadiazol-3- oder -5-yl, 1,2,3-Thiadiazol-4- oder -5-yl, 3- oder 4-Pyridazinyl oder Pyrazinyl.

Für die gesamte Erfindung gilt, daß sämtliche Reste, die mehrfach auftreten, gleich oder verschieden sein können, d.h. unabhängig voneinander sind.

30

35

Dementsprechend sind Gegenstand der Erfindung insbesondere diejenigen Verbindungen der Formel I, in denen mindestens einer der genannten Reste eine der vorstehend angegebenen bevorzugten Bedeutungen hat. Einige bevorzugte Gruppen von Verbindungen können durch die folgenden Teilformeln la bis le ausgedrückt werden, die der Formel I ent-

sprechen und worin die nicht näher bezeichneten Reste die bei der Formel I angegebene Bedeutung haben, worin jedoch

5	in la	x	Imidazolyl oder Pyridinyl bedeutet;
Ü	in Ib	R ¹ , R ²	jeweils unabhängig voneinander H, A, OA, NO ₂ , CF ₃ oder Hal, wobei mindestens einer der Reste R ¹ oder R ² immer ≠ H ist,
10		R ³ und R ⁴	zusammen -O-CH ₂ -CH ₂ -, -O-CH ₂ -O- oder -O-CH ₂ -CH ₂ -O, Imidazolyl oder Pyridinyl und
		n	1
	bedeu	ten;	
15			
	in Ic	R ¹ , R ²	jeweils unabhängig voneinander H, A, OA, NO ₂ , CF ₃ oder Hal,
			wobei mindestens einer der Reste R¹ oder R² immer ≠ H ist,
20		R ³ , R ⁴	jeweils unabhängig voneinander H, A, OA, Hal, NO ₂ , NH ₂ , NHA oder NAA',
		X	Imidazolyl oder Pyridinyl und
		n	1
	bedeu	ten;	
25			
	in Id	R ¹ und R ²	zusammen Alkylen mit 3-5 C-Atomen,
		R ³ und R ⁴	zusammen -O-CH ₂ -CH ₂ -, -O-CH ₂ -O- oder -O-CH ₂ -CH ₂ -O,
		X	Imidazolyl oder Pyridinyl und
30		n	1
	bedeut	en;	
35	in le	R ¹ und R ² R ³ , R ⁴	zusammen Alkylen mit 3-5 C-Atomen, jeweils unabhängig voneinander H, A, OA, Hal, NO ₂ , NH ₂ , NHA oder NAA',
		x	Imidazolyl oder Pyridinyl und

WO 98/06722 PCT/EP97/04139
- 8 -

n 1

bedeuten;

Die Verbindungen der Formel I und auch die Ausgangsstoffe zu ihrer
Herstellung werden im übrigen nach an sich bekannten Methoden hergestellt, wie sie in der Literatur (z.B. in den Standardwerken wie Houben-Weyl, Methoden der organischen Chemie, Georg-Thieme-Verlag, Stuttgart), beschrieben sind, und zwar unter Reaktionsbedingungen, die für die genannten Umsetzungen bekannt und geeignet sind. Dabei kann man auch von an sich bekannten, hier nicht näher erwähnten Varianten Gebrauch machen.

In den Verbindungen der Formeln II, III und IV haben R¹, R², R³, R⁴, X und n die angegebenen Bedeutungen, insbesondere die angegebenen bevorzugten Bedeutungen.

Falls L eine reaktionsfähige veresterte OH-Gruppe bedeutet, so ist diese vorzugsweise Alkylsulfonyloxy mit 1-6 C-Atomen (bevorzugt Methylsulfonyloxy) oder Arylsulfonyloxy mit 6-10 C-Atomen (bevorzugt Phenyloder p-Tolylsulfonyloxy, ferner auch 2-Naphthalinsulfonyloxy).

Die Ausgangsstoffe können, falls erwünscht, auch in situ gebildet werden, so daß man sie aus dem Reaktionsgemisch nicht isoliert, sondern sofort weiter zu den Verbindungen der Formel I umsetzt.

Andererseits ist es möglich, die Reaktion stufenweise durchzuführen.

Die Verbindungen der Formel I, worin X über N an das Thienopyrimidin-Ringsystem gebunden ist, können vorzugsweise erhalten werden, indem man Verbindungen der Formel II mit einem unsubstituierten oder ein-, zwei- oder dreifach durch A, Hal oder CF₃ substituierten ungesättigten 5-7gliedrigen Heterocyclus mit mindestens einer NH-Gruppe, worin zusätzlich weitere CH₂-Gruppen durch NH, NA, S oder O ersetzt sein können, umsetzt.

30

15

20

Die Ausgangsstoffe der Formeln II sind teilweise bekannt. Sofern sie nicht bekannt sind, können sie nach an sich bekannten Methoden hergestellt werden.

- 5 Vorstufen der Verbindungen der Formel II können z.B. durch Cyclisierung und Halogenierung analog J. Med. Chem. 24, 374 (1981) hergestellt werden. Durch anschließende Umsetzung mit Arylalkylaminen erhält man die Verbindungen der Formel II.
- 10 Im einzelnen erfolgt die Umsetzung der Verbindungen der Formel II mit dem NH-haltigen Heterocyclus in Gegenwart oder Abwesenheit eines inerten Lösungsmittels bei Temperaturen zwischen etwa -20 und etwa 150°, vorzugsweise zwischen 20 und 100°.
- 15 Der Zusatz eines säurebindenden Mittels, beispielsweise eines Alkali- oder Erdalkalimetall-hydroxids, -carbonats oder -bicarbonats oder eines anderen Salzes einer schwachen Säure der Alkali- oder Erdalkalimetalle, vorzugsweise des Kaliums, Natriums oder Calciums, oder der Zusatz einer organischen Base wie Triethylamin, Dimethylamin, Pyridin oder Chinolin 20 oder eines Überschusses der Aminkomponente kann günstig sein.

Als inerte Lösungsmittel eignen sich z.B. Kohlenwasserstoffe wie Hexan, Petrolether, Benzol, Toluol oder Xylol; chlorierte Kohlenwassertoffe wie Trichlorethylen, 1,2-Dichlorethan, Tetrachlorkohlenstoff, Chloroform oder Dichlormethan; Alkohole wie Methanol, Ethanol, Isopropanol, n-Propanol, n-Butanol oder tert.-Butanol; Ether wie Diethylether, Diisopropylether, Tetrahvdrofuran (THF) oder Dioxan; Glykolether wie Ethylenglykolmonomethyl- oder -monoethylether (Methylglykol oder Ethylglykol), Ethylenglykoldimethylether (Diglyme); Ketone wie Aceton oder Butanon; Amide wie Acetamid, Dimethylacetamid oder Dimethylformamid (DMF); Nitrile wie Acetonitril; Sulfoxide wie Dimethylsulfoxid (DMSO); Nitroverbindungen wie Nitromethan oder Nitrobenzol; Ester wie Ethylacetat oder Gemische der genannten Lösungsmittel.

25

30

Verbindungen der Formel I, worin X über C an das Thienopyrimidin-Ringsystem gebunden ist, können weiterhin erhalten werden, indem man Verbindungen der Formel III mit Verbindungen der Formel IV umsetzt. Die Ausgangsverbindungen der Formel IV und V sind in der Regel bekannt. Sind sie nicht bekannt, so können sie nach an sich bekannten Methoden hergestellt werden.

Verbindungen der Formel III können z.B. durch Umsetzung mit POCl₃ aus Verbindungen erhalten werden, die aus Thiophenderivaten und CN-substituierten Heterocyclen aufgebaut werden (Eur. J. Med. Chem. 23, 453 (1988).

Die Umsetzung der Verbindungen der Formel III mit Verbindungen der Formel IV erfolgt unter ähnlichen Bedingungen, betreffend die Reaktionszeit, Temperatur und Lösungsmittel, wie dies für die Umsetzung der Verbindungen der Formel II mit den NH-haltigen Heterocyclen beschrieben ist.

Es ist ferner möglich, in einer Verbindung der Formel I einen Rest R³ und/oder R⁴ in einen anderen Rest R³ und/oder R⁴ umzuwandeln, z.B. indem man Nitrogruppen (beispielsweise durch Hydrierung an Raney-Nickel oder Pd-Kohle in einem inerten Lösungsmittel wie Methanol oder Ethanol) zu Aminogruppen reduziert oder Cyangruppen zu COOH-Gruppen hydrolysiert.

Ferner kann man freie Aminogruppen in üblicher Weise mit einem Säurechlorid oder -anhydrid acylieren oder mit einem unsubstituierten oder substituierten Alkylhalogenid alkylieren, zweckmäßig in einem inerten Lösungsmittel wie Dichlormethan oder THF und /oder in Gegenwart einer Base wie Triethylamin oder Pyridin bei Temperaturen zwischen -60 und +30°.

30

35

5

10

15

20

25

Eine Base der Formel I kann mit einer Säure in das zugehörige Säureadditionssalz übergeführt werden, beispielsweise durch Umsetzung äquivalenter Mengen der Base und der Säure in einem inerten Lösungsmittel
wie Ethanol und anschließendes Eindampfen. Für diese Umsetzung
kommen insbesondere Säuren in Frage, die physiologisch unbedenkliche
Salze liefern. So können anorganische Säuren verwendet werden, z.B.

Schwefelsäure, Salpetersäure, Halogenwasserstoffsäuren wie Chlorwasserstoffsäure oder Bromwasserstoffsäure, Phosphorsäuren wie Orthophosphorsäure, Sulfaminsäure, ferner organische Säuren, insbesondere aliphatische, alicyclische, araliphatische, aromatische oder heterocyclische ein- oder mehrbasige Carbon-, Sulfon- oder Schwefelsäuren, z.B. Ameisensäure, Essigsäure, Propionsäure, Pivalinsäure, Diethylessigsäure, Malonsäure, Bernsteinsäure, Pimelinsäure, Fumarsäure, Maleinsäure, Milchsäure, Weinsäure, Äpfelsäure, Citronensäure, Gluconsäure, Ascorbinsäure, Nicotinsäure, Isonicotinsäure, Methan- oder Ethansulfonsäure, Ethandisulfonsäure, 2-Hydroxyethansulfonsäure, Benzolsulfonsäure, p-Toluoisulfonsäure, Naphthalin-mono- und Disulfonsäuren, Laurylschwefelsäure. Salze mit physiologisch nicht unbedenklichen Säuren, z.B. Pikrate, können zur Isolierung und /oder Aufreinigung der Verbindungen der Formel I verwendet werden.

15

10

5

Andererseits können, falls gewünscht, die freien Basen der Formel I aus ihren Salzen mit Basen (z.B. Natrium- oder Kaliumhydroxid oder carbonat) in Freiheit gesetzt werden.

20 Gegenstand der Erfindung ist ferner die Verwendung der Verbindungen der Formel I und/oder ihrer physiologisch unbedenklichen Salze zur Herstellung pharmazeutischer Zubereitungen, insbesondere auf nicht-chemischem Wege. Hierbei können sie zusammen mit mindestens einem festen. flüssigen und/oder halbflüssigen Träger- oder Hilfsstoff und gegebenen-25 falls in Kombination mit einem oder mehreren weiteren Wirkstoffen in eine geeignete Dosierungsform gebracht werden.

Gegenstand der Erfindung sind auch Arzneimittel der Formel I und ihre physiologisch unbedenklichen Salze als Phosphodiesterase V-Hemmer.

30

Gegenstand der Erfindung sind ferner pharmazeutische Zubereitungen, enthaltend mindestens eine Verbindung der Formel I und/oder eines ihrer physiologisch unbedenklichen Salze.

35 Diese Zubereitungen können als Arzneimittel in der Human- oder Veterinärmedizin verwendet werden. Als Trägerstoffe kommen organische 5

30

oder anorganische Substanzen in Frage, die sich für die enterale (z.B. orale), parenterale oder topische Applikation eignen und mit den neuen Verbindungen nicht reagieren, beispielsweise Wasser, pflanzliche Öle. Benzylalkohole, Alkylengiykole, Polyethylengiykole, Glycerintriacetat, Gelatine, Kohlehydrate wie Lactose oder Stärke, Magnesiumstearat, Talk, Vaseline. Zur oralen Anwendung dienen insbesondere Tabletten, Pillen, Dragees, Kapseln, Pulver, Granulate, Sirupe, Säfte oder Tropfen, zur rektalen Anwendung Suppositorien, zur parenteralen Anwendung Lösungen, vorzugsweise ölige oder wässrige Lösungen, ferner Suspensionen, 10 Emulsionen oder Implantate, für die topische Anwendung Salben, Cremes oder Puder. Die neuen Verbindungen können auch lyophilisiert und die erhaltenen Lyophilisate z.B. zur Herstellung von Injektionspräparaten verwendet werden. Die angegebenen Zubereitungen können sterilisiert sein und/oder Hilfsstoffe wie Gleit-, Konservierungs-, Stabilisierungs-15 und/oder Netzmittel, Emulgatoren, Salze zur Beeinflussung des osmotischen Druckes, Puffersubstanzen, Farb-, Geschmacks- und /oder ein oder weitere Wirkstoffe enthalten, z.B. ein oder mehrere Vitamine.

PCT/EP97/04139

Die Verbindungen der Formel I und ihre physiologisch unbedenklichen 20 Salze können bei der Bekämpfung von Krankheiten, bei denen eine Erhöhung des cGMP(cyclo-Guanosin-monophosphat)-Spiegels zu Entzündungshemmung oder -verhinderung und Muskelentspannung führt, eingesetzt werden. Besondere Verwendung können die erfindungsgemäßen Verbindungen bei der Behandlung von Krankheiten des Herz-25 Kreislaufsystems und zur Therapie von Potenzstörungen finden.

> Vor- und nachstehend sind alle Temperaturen in °C angegeben. In den nachfolgenden Beispielen bedeutet "übliche Aufarbeitung": Man gibt, falls erforderlich, Wasser hinzu, stellt, falls erforderlich, je nach Konstitution des Endprodukts auf pH-Werte zwischen 2 und 10 ein, extrahiert mit Ethylacetat oder Dichlormethan, trennt ab, trocknet die organische Phase über Natriumsulfat, dampft ein und reinigt durch Chromatographie an Kieselgel und /oder durch Kristallisation.

35 Massenspektrometrie (MS): El (Elektronenstoß-lonisation) M^{*} FAB (Fast Atom Bombardment) (M+H)*

- 13 -

Beispiel 1

Eine Lösung von 3,29 g 2,4-Dichlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin in 80 ml Dichlormethan wird mit 3,02 g 3,4-Methylendioxybenzylamin ("A") versetzt und nach Zugabe von 1,52 g Triethylamin 12 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Das Lösungsmittel wird entfernt und wie üblich aufgearbeitet. Man erhält 3,38 g 2-Chlor-6-methyl-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin, F. 162°.

10

Analog erhält man durch Umsetzung von "A"

- mit 2,4-Dichlor-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-Chlor-5-methyl-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 2,4-Dichlor-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-Chlor-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin, F. 222°;

20

35

15

- mit 2,4-Dichlor-5,6-cyclopenteno-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-Chlor-5,6-cyclopenteno-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 25 mit 2,4-Dichlor-5,6-cyclohepteno-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-Chlor-5,6-cyclohepteno-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 2,4-Dichlor-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

 2-Chlor-6-ethyl-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]pyrimidin, F. 148°;
 - mit 2,4,6-Trichlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
 2,6-Dichlor-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]pyrimidin;

WO 98/06722 - 14 -

	mit 2,4,5-Trichlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2,5-Dichlor-6-methyl-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]
	d]-pyrimidin;
5	mit 2,4-Dichlor-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
	2-Chlor-6-nitro-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	mit 2,4-Dichlor-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
10	2-Chlor-5,6-dimethyl-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	mit 2,4-Dichlor-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
15	2-Chlor-6-trifluormethyl-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin.
	Analog erhält man durch Umsetzung von 3-Chlor-4-methoxy-benzylamin mit 2,4-Dichlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
	2-Chlor-6-methyl-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-
20	pyrimidin;
	mit 2,4-Dichlor-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
	2-Chlor-5-methyl-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
25	
	mit 2,4-Dichlor-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-Chlor-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-[1]-
	benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
30	mit 2,4-Dichlor-5,6-cyclopenteno-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin
	2-Chlor-5,6-cyclopenteno-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	mit 2,4-Dichlor-5,6-cyclohepteno-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin
35	2-Chlor-5,6-cyclohepteno-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

	mit 2,4-Dichlor-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-Chlor-6-ethyl-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-
5	pyrimidin;
<i>3</i>	mit 2,4,6-Trichlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2,6-Dichlor-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
10	mit 2,4,5-Trichlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2,5-Dichlor-6-methyl-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
15	mit 2,4-Dichlor-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-Chlor-6-nitro-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]- pyrimidin;
20	mit 2,4-Dichlor-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-Chlor-5,6-dimethyl-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
25	mit 2,4-Dichlor-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-Chlor-6-trifluormethyl-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno- [2,3-d]-pyrimidin.
	Analog erhält man durch Umsetzung von 3,4-Dimethoxy-benzylamin mit 2,4-Dichlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-Chlor-6-methyl-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
30	mit 2,4-Dichlor-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-Chlor-5-methyl-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]- pyrimidin;
35	mit 2,4-Dichlor-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin

WO 98/06722 PCT/EP97/04139

	2-Chlor-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
5	mit 2,4-Dichlor-5,6-cyclopenteno-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-Chlor-5,6-cyclopenteno-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
10	mit 2,4-Dichlor-5,6-cyclohepteno-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-Chlor-5,6-cyclohepteno-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
15	mit 2,4-Dichlor-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-Chlor-6-ethyl-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]- pyrimidin;
13	mit 2,4,6-Trichlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2,6-Dichlor-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20	mit 2,4,5-Trichlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2,5-Dichlor-6-methyl-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]- pyrimidin;
25	mit 2,4-Dichlor-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-Chlor-6-nitro-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]- pyrimidin;
30	mit 2,4-Dichlor-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-Chlor-5,6-dimethyl-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]- pyrimidin;
	mit 2,4-Dichlor-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-Chlor-6-trifluormethyl-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d] pyrimidin.
35	Analog erhält man durch Umsetzung von Benzylamin

mit 2,4-Dichlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

	pyrimidin;
5	mit 2,4-Dichlor-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
3	2-Chlor-5-methyl-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
40	mit 2,4-Dichlor-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-Chlor-5,6,7,8-tetrahydro-4-benzylamino-[1]- benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
10	mit 2.4 Diabler 5.6 evalenentene (4) hermathians (2.2 d) municidia
	mit 2,4-Dichlor-5,6-cyclopenteno-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-Chlor-5,6-cyclopenteno-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	mit 2,4-Dichlor-5,6-cyclohepteno-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin
15	2-Chlor-5,6-cyclohepteno-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	mit 2,4-Dichlor-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
	2-Chlor-6-ethyl-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20	mit 2,4,6-Trichlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
	2,6-Dichlor-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	mit 2,4,5-Trichlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
25	2,5-Dichlor-6-methyl-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
25	mit 2,4-Dichlor-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
	2-Chlor-6-nitro-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	mit 2,4-Dichlor-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
30	2-Chlor-5,6-dimethyl-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	mit 2,4-Dichlor-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
	2-Chlor-6-trifluormethyl-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin.
35	Analog erhält man durch Umsetzung von 4-Fluorbenzylamin
	mit 2,4-Dichlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

35

pyrimidin.

2-Chlor-6-methyl-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin; mit 2,4-Dichlor-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-Chlor-5-methyl-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin; 5 mit 2,4-Dichlor-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-Chlor-5,6,7,8-tetrahydro-4-(4-fluorbenzylamino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin; 10 mit 2,4-Dichlor-5,6-cyclopenteno-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-Chlor-5,6-cyclopenteno-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]pyrimidin; mit 2,4-Dichlor-5,6-cyclohepteno-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin 15 2-Chlor-5,6-cyclohepteno-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]pyrimidin; mit 2,4-Dichlor-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-Chlor-6-ethyl-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin; 20 mit 2,4,6-Trichlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2,6-Dichlor-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin; mit 2,4,5-Trichlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 25 2,5-Dichlor-6-methyl-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin; mit 2,4-Dichlor-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-Chlor-6-nitro-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin; 30 mit 2,4-Dichlor-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-Chlor-5,6-dimethyl-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin; mit 2,4-Dichlor-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-Chlor-6-trifluormethyl-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-

	mit 2,4-Dichlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
	2-Chlor-6-methyl-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
5	mit 2,4-Dichlor-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
	2-Chlor-5-methyl-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	mit 2,4-Dichlor-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin
10	2-Chlor-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	mit 2,4-Dichlor-5,6-cyclopenteno-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin
	2-Chlor-5,6-cyclopenteno-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
15	
	mit 2,4-Dichlor-5,6-cyclohepteno-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-Chlor-5,6-cyclohepteno-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]- pyrimidin;
20	mit 2,4-Dichlor-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
	2-Chlor-6-ethyl-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	mit 2,4,6-Trichlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
25	2,6-Dichlor-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	mit 2,4,5-Trichlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
	2,5-Dichlor-6-methyl-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
30	mit 2,4-Dichlor-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
	2-Chlor-6-nitro-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	mit 2,4-Dichlor-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
35	2-Chlor-5,6-dimethyl-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]- pyrimidin;
	1. X

WO 98/06722 PCT/EP97/04139

mit 2,4-Dichlor-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-Chlor-6-trifluormethyl-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]- pyrimidin.
Analog erhält man durch Umsetzung von 3-Nitrobenzylamin mit 2,4-Dichlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-Chlor-6-methyl-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
mit 2,4-Dichlor-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-Chlor-5-methyl-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
mit 2,4-Dichlor-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-Chlor-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3-nitrobenzylamino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
mit 2,4-Dichlor-5,6-cyclopenteno-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-Chlor-5,6-cyclopenteno-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
mit 2,4-Dichlor-5,6-cyclohepteno-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-Chlor-5,6-cyclohepteno-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
mit 2,4-Dichlor-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-Chlor-6-ethyl-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
mit 2,4,6-Trichlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2,6-Dichlor-4-(3-nitrobenzylamin)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
mit 2,4,5-Trichlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2,5-Dichlor-6-methyl-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
mit 2,4-Dichlor-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-Chlor-6-nitro-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
mit 2,4-Dichlor-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

WO 98/06722 PCT/EP97/04139

2-Chlor-5,6-dimethyl-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin:

mit 2,4-Dichlor-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-Chlor-6-trifluormethyl-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin.

5

10

15

30

35

Analog erhält man durch Umsetzung von 3,4-Methylendioxyphenethylamin mit 2,4-Dichlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-Chlor-6-methyl-4-(3,4-methylenphenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 2,4-Dichlor-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-Chlor-5-methyl-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 2,4-Dichlor-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-Chlor-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;

- 20 mit 2,4-Dichlor-5,6-cyclopenteno-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-Chlor-5,6-cyclopenteno-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 2,4-Dichlor-5,6-cyclohepteno-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin
 2-Chlor-5,6-cyclohepteno-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
 - mit 2,4-Dichlor-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

 2-Chlor-6-ethyl-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-thieno-[2,3-d]pyrimidin;
 - mit 2,4,6-Trichlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2,6-Dichlor-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 2,4,5-Trichlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

WO 98/06722 PCT/EP97/04139
- 22 -

2,5-Dichlor-6-methyl-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 2,4-Dichlor-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

2-Chlor-6-nitro-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-thieno-[2,3-d]pyrimidin;

5

10

15

20

- mit 2,4-Dichlor-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
 2-Chlor-5,6-dimethyl-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-thieno[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 2,4-Dichlor-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-Chlor-6-trifluormethyl-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin.

Analog erhält man durch Umsetzung von 3,4-Ethylendioxybenzylamin mit 2,4-Dichlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-Chlor-6-methyl-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 2,4-Dichlor-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-Chlor-5-methyl-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

- 25 mit 2,4-Dichlor-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-Chlor-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 2,4-Dichlor-5,6-cyclopenteno-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin

 2-Chlor-5,6-cyclopenteno-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-thieno[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 2,4-Dichlor-5,6-cyclohepteno-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin
 2-Chlor-5,6-cyclohepteno-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-thieno[2,3-d]-pyrimidin;

4-Dichlor-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-Chlor-6-ethyl-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;

- 5 mit 2,4,6-Trichlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2,6-Dichlor-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 2,4,5-Trichlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2,5-Dichlor-6-methyl-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-10 pyrimidin;
 - mit 2,4-Dichlor-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-Chlor-6-nitro-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]pyrimidin:

mit 2,4-Dichlor-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-Chlor-5,6-dimethyl-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]pyrimidin;

20 mit 2,4-Dichlor-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-Chlor-6-trifluormethyl-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin.

Beispiel 2

1,67 g 2-Chlor-6-methyl-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]pyrimidin, 1,02 g Imidazol und 2 g Phenol werden 5 Stunden bei 150 ° erhitzt. Nach Abkühlen wird der Rückstand in Dichlormethan gelöst und wie üblich aufgearbeitet. Man erhält 1,0 g 2-(Imidazol-1-yl)-6-methyl-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin, F. 248-250°.

Analog erhält man durch Umsetzung von Imidazol mit den unter Beispiel 1 erhaltenen 2-Chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin-Derivaten, die in 4-Stellung Arylalkylamino-substituiert sind, die nachstehenden Verbindungen

25

30

15

2-(Imidazol-1-yl)-5-methyl-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin, F. 238°;

- 24 -

- 2-(Imidazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin, F. 218°;
- 2-(Imidazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin, F. 260°;
- 2-(Imidazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin, F. 210°;
- 2-(Imidazol-1-yl)-6-ethyl-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin, Methansulfonat, F. 201°;
- 2-(Imidazol-1-yl)-6-chlor-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(Imidazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(Imidazol-1-yl)-6-nitro-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(lmidazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin, F. 245°
- 2-(lmidazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(Imidazol-1-yl)-6-methyl-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(Imidazol-1-yl)-5-methyl-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

		2-(Imidazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3-chlor-4-methoxybenzyl-amino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	5	2-(Imidazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-(3-chlor-4-methoxybenzyl-amino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
		2-(Imidazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-(3-chlor-4-methoxybenzyl-amino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	10	2-(Imidazol-1-yl)-6-ethyl-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	15	2-(Imidazol-1-yl)-6-chlor-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	15	2-(Imidazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	20	2-(Imidazol-1-yl)-6-nitro-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
		2-(Imidazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	25	2-(Imidazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
30	20	2-(Imidazol-1-yl)-6-methyl-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	30	2-(Imidazol-1-yl)-5-methyl-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	35	2-(Imidazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;

	2-(Imidazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
5	2-(Imidazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(Imidazol-1-yl)-6-ethyl-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
10	2-(Imidazol-1-yl)-6-chlor-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
45	2-(Imidazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
15	2-(Imidazol-1-yl)-6-nitro-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20	2-(Imidazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(Imidazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
25	2-(Imidazol-1-yl)-6-methyl-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(Imidazol-1-yl)-6-methyl-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin, F. 207°;
30	2-(Imidazol-1-yl)-5-methyl-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(Imidazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-benzylamino-[1]-benzothieno- [2,3-d]-pyrimidin;
3 5	

	2-(Imidazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
5	2-(Imidazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin, F. 197°;
	2-(Imidazol-1-yl)-6-ethyl-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
10	2-(Imidazol-1-yl)-6-chlor-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
10	2-(Imidazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
15	2-(Imidazol-1-yl)-6-nitro-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
15	2-(Imidazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20	2-(Imidazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20	2-(Imidazol-1-yl)-6-methyl-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
25	2-(Imidazol-1-yl)-5-methyl-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(Imidazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-(4-fluorbenzylamino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
30	2-(Imidazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
35	2-(Imidazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

- 2-(Imidazol-1-yl)-6-ethyl-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin, F. 199°;
- 2-(Imidazol-1-yl)-6-chlor-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(lmidazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(Imidazol-1-yl)-6-nitro-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(lmidazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(Imidazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(Imidazol-1-yl)-6-methyl-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(Imidazol-1-yl)-5-methyl-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(Imidazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(Imidazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(Imidazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(Imidazol-1-yl)-6-ethyl-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

	2-(Imidazol-1-yl)-6-chlor-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
5	2-(Imidazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(Imidazol-1-yl)-6-nitro-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
10	2-(Imidazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
15	2-(Imidazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(Imidazol-1-yl)-6-methyl-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20	2-(Imidazol-1-yl)-5-methyl-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(Imidazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3-nitrobenzylamino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
25	2-(Imidazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
30	2-(Imidazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(Imidazol-1-yl)-6-ethyl-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
35	2-(Imidazol-1-yl)-6-chlor-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

	2-(Imidazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
5	2-(Imidazol-1-yl)-6-nitro-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(Imidazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
10	2-(Imidazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
15	2-(Imidazol-1-yl)-6-methyl-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(Imidazol-1-yl)-5-methyl-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20	2-(Imidazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3,4-methylendioxy-phenethylamino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(Imidazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
25	2-(Imidazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
30	2-(Imidazol-1-yl)-6-ethyl-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(Imidazol-1-yl)-6-chlor-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
35	2-(Imidazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-(3,4-methylendioxy-phenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

	2-(Imidazol-1-yl)-6-nitro-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
5	2-(Imidazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(Imidazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-(3,4-methylendioxy-phenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin.
10	2-(Imidazol-1-yl)-6-methyl-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
15	2-(Imidazol-1-yl)-5-methyl-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(Imidazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20	2-(Imidazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(Imidazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
25	2-(Imidazol-1-yl)-6-ethyl-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
30	2-(Imidazol-1-yl)-6-chlor-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(Imidazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
35	2-(Imidazol-1-yl)-6-nitro-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

WO 98/06722 PCT/EP97/04139 - 32 -

	2-(Imidazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
5	2-(Imidazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin.
10	Analog erhält man durch Umsetzung von Pyrazol mit den unter Beispiel 1 erhaltenen 2-Chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin-Derivaten, die in 4-Stellung Arylalkylamino-substituiert sind, die nachstehenden Verbindungen
	2-(Pyrazol-1-yl)-5-methyl-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
15	2-(Pyrazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3,4-methylendioxybenzyl-amino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin, F. 210°;
	2-(Pyrazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20	2-(Pyrazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
25	2-(Pyrazol-1-yl)-6-ethyl-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(Pyrazol-1-yl)-6-chlor-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
30	2-(Pyrazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(Pyrazol-1-yl)-6-nitro-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
35	2-(Pyrazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

	2-(Pyrazol-1-yl)-6-trifluomethyl-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
5	2-(Pyrazol-1-yl)-6-methyl-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
10	2-(Pyrazol-1-yl)-5-methyl-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(Pyrazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3-chlor-4-methoxybenzyl-amino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
15	2-(Pyrazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-(3-chlor-4-methyoxybenzyl-amino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(Pyrazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-(3-chlor-4-methyoxybenzyl-amino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20	2-(Pyrazol-1-yl)-6-ethyl-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
25	2-(Pyrazol-1-yl)-6-chlor-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(Pyrazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
30	2-(Pyrazol-1-yl)-6-nitro-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(Pyrazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
35	2-(Pyrazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

	2-(Pyrazol-1-yl)-6-methyl-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
5	2-(Pyrazol-1-yl)-5-methyl-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
10	2-(Pyrazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(Pyrazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
15	2-(Pyrazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(Pyrazol-1-yl)-6-ethyl-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20	2-(Pyrazol-1-yl)-6-chlor-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
2 5	2-(Pyrazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(Pyrazol-1-yl)-6-nitro-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
30	2-(Pyrazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(Pyrazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
35	2-(Pyrazol-1-yl)-6-methyl-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

	2-(Pyrazol-1-yl)-5-methyl-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
5	2-(Pyrazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-benzylamino-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(Pyrazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
10	2-(Pyrazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
•	2-(Pyrazol-1-yl)-6-ethyl-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
15	2-(Pyrazol-1-yl)-6-chlor-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(Pyrazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20	2-(Pyrazol-1-yl)-6-nitro-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(Pyrazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
25	2-(Pyrazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(Pyrazol-1-yl)-6-methyl-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
30	2-(Pyrazol-1-yl)-5-methyl-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
35	2-(Pyrazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-(4-fluorbenzylamino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;

	2-(Pyrazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
5	2-(Pyrazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(Pyrazol-1-yl)-6-ethyl-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
10	2-(Pyrazol-1-yl)-6-chlor-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
15	2-(Pyrazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
10	2-(Pyrazol-1-yl)-6-nitro-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20	2-(Pyrazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(Pyrazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
25	2-(Pyrazol-1-yl)-6-methyl-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
30	2-(Pyrazol-1-yl)-5-methyl-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(Pyrazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
35	2-(Pyrazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

2-(Pyrazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin; 2-(Pyrazol-1-yl)-6-ethyl-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-5 pyrimidin; 2-(Pyrazol-1-yl)-6-chlor-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]pyrimidin: 10 2-(Pyrazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin; 2-(Pyrazol-1-yl)-6-nitro-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]pyrimidin; 15 2-(Pyrazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3d]-pyrimidin; 2-(Pyrazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-20 [2,3-d]-pyrimidin; 2-(Pyrazol-1-yl)-6-methyl-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]pyrimidin; 25 2-(Pyrazol-1-yl)-5-methyl-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]pyrimidin; 2-(Pyrazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3-nitrobenzylamino)-[1]benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin; 30 2-(Pyrazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3d]-pyrimidin; 2-(Pyrazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-35 d]-pyrimidin;

	2-(Pyrazol-1-yl)-6-ethyl-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
5	2-(Pyrazol-1-yl)-6-chlor-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(Pyrazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
10	2-(Pyrazol-1-yl)-6-nitro-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
15	2-(Pyrazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(Pyrazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20	2-(Pyrazol-1-yl)-6-methyl-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(Pyrazol-1-yl)-5-methyl-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
25	2-(Pyrazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3,4-methylendioxy-phenethylamino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
30	2-(Pyrazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(Pyrazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
35	2-(Pyrazol-1-yl)-6-ethyl-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

	2-(Pyrazol-1-yl)-6-chlor-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
5	2-(Pyrazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-(3,4-methylendioxy-phenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(Pyrazol-1-yl)-6-nitro-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
10	2-(Pyrazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
15	2-(Pyrazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-(3,4-methylendioxyphenethyl amino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(Pyrazol-1-yl)-6-methyl-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20	2-(Pyrazol-1-yl)-5-methyl-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(Pyrazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
25	2-(Pyrazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
30	2-(Pyrazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(Pyrazol-1-yl)-6-ethyl-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
35	2-(Pyrazol-1-yl)-6-chlor-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

	2-(Pyrazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
5	2-(Pyrazol-1-yl)-6-nitro-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(Pyrazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
10	2-(Pyrazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin.
15	Analog erhält man durch Umsetzung von 1,2,4-Triazol mit den unter Beispiel 1 erhaltenen 2-Chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin-Derivaten, die in 4- Stellung Arylalkylamino-substituiert sind, die nachstehenden Verbindungen
	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5-methyl-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3,4-methylendioxybenzyl-amino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
25	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-(3,4-methylendioxybenzyl-amino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-(3,4-methylendioxybenzyl-amino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
30	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-ethyl-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-chlor-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
35	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-(3,4-methylendioxybenzyl-amino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-nitro-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
5	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
10	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-(3,4-methylendioxybenzyl-amino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
10	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-methyl-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
15	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5-methyl-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-(3-chlor-4-methyoxybenzyl-amino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
25	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-(3-chlor-4-methyoxybenzyl-amino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-ethyl-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
30	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-chlor-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-(3-chlor-4-methoxybenzyl-amino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
35	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-nitro-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)thieno-[2,3-d]-pyrimidin; 5 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin; 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-methyl-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin; 10 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5-methyl-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin; 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3,4-dimethoxybenzyl-15 amino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin; 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin; 20 2-(1.2,4-Triazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin; 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-ethyl-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin; 25 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-chlor-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin; 2-(1.2,4-Triazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-30 thieno-[2,3-d]-pyrimidin; 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-nitro-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin; 35 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
5	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-methyl-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5-methyl-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
10	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-benzylamino-[1]-benzo-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
15	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
15	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-ethyl-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-chlor-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
25	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
25	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-nitro-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
30	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
35	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-methyl-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5-methyl-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
5	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-(4-fluorbenzylamino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
10	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
15	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-ethyl-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-chlor-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-nitro-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
25	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
30	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-methyl-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
35	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5-methyl-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin; 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-5 thieno-[2,3-d]-pyrimidin; 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-(3,4-dichlorbenzylamino)thieno-[2,3-d]-pyrimidin; 10 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-ethyl-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3d]-pyrimidin; 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-chlor-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3d]-pyrimidin; 15 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-(3,4-dichlorbenzylamino)thieno-[2,3-d]-pyrimidin; 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-nitro-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-20 d]-pyrimidin; 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin; 25 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-(3,4-dichlorbenzylamino)thieno-[2,3-d]-pyrimidin; 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-methyl-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]pyrimidin; 30 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5-methyl-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]pyrimidin; 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3-nitrobenzylamino)-[1]-35 benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;

	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
5	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-ethyl-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
10	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-chlor-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
15	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
10	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-nitro-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
25	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-methyl-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
30	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5-methyl-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3,4-methylendioxy-phenethylamino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
35	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-(3,4-methylendioxy-phenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-(3,4-methylendioxy-phenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
5	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-ethyl-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-chlor-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
10	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-(3,4-methylendioxy-phenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
15	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-nitro-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
10	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-(3,4-methylendioxyphenethyl amino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-methyl-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
25	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5-methyl-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
30	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
35	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-ethyl-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
5	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-chlor-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-(3,4-ethylendioxy-benzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
10	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-nitro-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
15	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-(3,4-ethylendioxybenzyl-amino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin.
20	Analog erhält man durch Umsetzung von 2-Methylimidazol mit den unter Beispiel 1 erhaltenen 2-Chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin-Derivaten, die in 4-Stellung Arylalkylamino-substituiert sind, die nachstehenden Verbindungen
25	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5-methyl-4-(3,4-methylendioxybenzyl-amino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin, amorph;
30	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
35	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-ethyl-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-chlor-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
5	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
10	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-nitro-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
10	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-(3,4-methylendioxybenzyl-amino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
15	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-methyl-4-(3-chlor-4-methoxybenzyl-amino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5-methyl-4-(3-chlor-4-methoxybenzyl-amino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
25	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3-chlor-4-methoxy-benzylamino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-(3-chlor-4-methyoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
30	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-(3-chlor-4-methoxybenzyl-amino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-ethyl-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
35	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-chlor-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
5	2-(2-Methyl-1-yl)-6-nitro-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
10	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-(3-chlor-4-methoxybenzyl-amino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-(3-chlor-4-methoxybenzyl-amino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
15	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-methyl-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5-methyl-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3,4-dimethoxybenzyl-amino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
25	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-(3,4-dimethoxybenzyl-amino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-(3,4-dimethoxybenzyl-amino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
30	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-ethyl-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-chlor-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
35	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-(3,4-dimethoxybenzyl-amino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-nitro-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
5	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
10	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-(3,4-dimethoxybenzyl-amino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
10	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-methyl-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
15	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5-methyl-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-benzylamino-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
25	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-ethyl-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
30	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-chlor-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
35	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-nitro-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
5	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
10	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-methyl-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
•	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5-methyl-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
15	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-(4-fluorbenzylamino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
25	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-ethyl-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
_	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-chlor-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
30	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-nitro-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
35	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
5	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-methyl-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
10	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5-methyl-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
15	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-(3,4-dichlorbenzyl-amino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-(3,4-dichlorbenzyl-amino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-ethyl-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
25	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-chlor-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-(3,4-dichlorbenzyl-amino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
30	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-nitro-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
35	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-methyl-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
5	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5-methyl-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
10	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3-nitrobenzylamino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
15	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-ethyl-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-chlor-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
25	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-nitro-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
30	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
35	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-methyl-4-(3,4-methylendioxy-phenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5-methyl-4-(3,4-methylendioxy-phenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
5	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3,4-methylendioxy-phenethylamino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
10	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-(3,4-methylendioxy-phenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
10	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-(3,4-methylendioxy-phenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
15	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-ethyl-4-(3,4-methylendioxy-phenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-chlor-4-(3,4-methylendioxy-phenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-(3,4-methylendioxy-phenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
25	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-nitro-4-(3,4-methylendioxy-phenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-(3,4-methylendioxy-phenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
30	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-(3,4-methylendioxy-phenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-methyl-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
35	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5-methyl-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
5	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
10	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-ethyl-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
15	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-chlor-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-(3,4-ethylendioxy-benzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-nitro-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
25	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-(3,4-ethylendioxybenzyl-amino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin.
	Beispiel 3

35

5 g 2-Amino-5-methyl-3-ethoxycarbonyl-thiophen wird mit 2,7 g 3-Cyan-pyridin in 40 ml Dioxan gelöst. Anschließend wird für 5 Stunden gasförmiges HCl durch die Lösung geleitet. Nach üblicher Aufarbeitung erhält man 6 g 3,4-Dihydro-4-oxo-2-(pyridin-3-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin.

Der Ersatz der Ketogruppe durch CI unter Ausbildung des aromatischen Pyrimidinrings erfolgt unter Standardbedingungen. Eine Mischung aus 18 ml POCI₃ mit 6 g 3,4-Dihydro-4-oxo-2-(pyridin-3-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin unter Zusatz von 1,8 ml N,N-Dimethyl-5 anilin wird 4 Stunden gekocht. Nach üblicher Aufarbeitung erhält man 5 g 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin. Analog erhält man durch Umsetzung von 3-Cyanpyridin und anschließender Reaktion mit POCI3 10 aus 2-Amino-4-methyl-3-ethoxycarbonyl-thiophen 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin; aus 2-Amino-4,5,6,7-tetrahydro-3-ethoxycarbonyl-benzothiophen 15 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]pyrimidin, F. 143°; aus 2-Amino-4,5-cyclopenteno-3-ethoxycarbonyl-thiophen 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin; 20 aus 2-Amino-4,5-cyclohepteno-3-ethoxycarbonyl-thiophen 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin; aus 2-Amino-5-ethyl-3-ethoxycarbonyl-thiophen 25 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin; aus 2-Amino-5-chlor-3-ethoxycarbonyl-thiophen 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin: 30 aus 2-Amino-4-chlor-5-methyl-3-ethoxycarbonyl-thiophen 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin; aus 2-Amino-5-nitro-3-ethoxycarbonyl-thiophen 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin; 35 aus 2-Amino-4,5-dimethyl-3-ethoxycarbonyl-thiophen

	4-Chior-2-(pyridin-3-yi)-5,6-dimetriyi-tnieno-[2,3-dj-pyrimidin;
	aus 2-Amino-5-trifluormethyl-3-ethoxycarbonyl-thiophen
5	4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin.
	Analog erhält man durch Umsetzung von 5-Cyanisoxazol und
	anschließender Reaktion mit POCI ₃
40	aus 2-Amino-5-methyl-3-ethoxycarbonyl-thiophen
10	4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	aus 2-Amino-4-methyl-3-ethoxycarbonyl-thiophen
	4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
15	aus 2-Amino-4,5,6,7-tetrahydro-3-ethoxycarbonyl-benzothiophen
	4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d] pyrimidin;
	aus 2-Amino-4,5-cyclopenteno-3-ethoxycarbonyl-thiophen
20	4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	aus 2-Amino-4,5-cyclohepteno-3-ethoxycarbonyl-thiophen
	4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
25	aus 2-Amino-5-ethyl-3-ethoxycarbonyl-thiophen
	4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	aus 2-Amino-5-chlor-3-ethoxycarbonyl-thiophen
30	4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	aus 2-Amino-4-chlor-5-methyl-3-ethoxycarbonyl-thiophen
	4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
0.5	aus 2-Amino-5-nitro-3-ethoxycarbonyl-thiophen
35	4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

	aus 2-Amino-4,5-dimethyl-3-ethoxycarbonyl-thiophen
	4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	aus 2-Amino-5-trifluormethyl-3-ethoxycarbonyl-thiophen
5	4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin.
	Analog erhält man durch Umsetzung von 2-Cyanpyrazin und anschließender Reaktion mit POCI ₃
10	aus 2-Amino-5-methyl-3-ethoxycarbonyl-thiophen
	4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	aus 2-Amino-4-methyl-3-ethoxycarbonyl-thiophen
15	4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
10	aus 2-Amino-4,5,6,7-tetrahydro-3-ethoxycarbonyl-benzothiophen 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20	aus 2-Amino-4,5-cyclopenteno-3-ethoxycarbonyl-thiophen
	4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	aus 2-Amino-4,5-cyclohepteno-3-ethoxycarbonyl-thiophen
25	4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20	aus 2-Amino-5-ethyl-3-ethoxycarbonyl-thiophen
	4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	aus 2-Amino-5-chlor-3-ethoxycarbonyl-thiophen
30	4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	aus 2-Amino-4-chlor-5-methyl-3-ethoxycarbonyl-thiophen
	4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
35	aus 2-Amino-5-nitro-3-ethoxycarbonyl-thiophen
	4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

	aus 2-Amino-4,5-dimethyl-3-ethoxycarbonyl-thiophen 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
5	aus 2-Amino-5-trifluormethyl-3-ethoxycarbonyl-thiophen 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin.
10	Analog erhält man durch Umsetzung von 2-Cyanpyridin und anschließender Reaktion mit POCI ₃
	aus 2-Amino-5-methyl-3-ethoxycarbonyl-thiophen 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
15	aus 2-Amino-4-methyl-3-ethoxycarbonyl-thiophen 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20	aus 2-Amino-4,5,6,7-tetrahydro-3-ethoxycarbonyl-benzothiophen 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d] pyrimidin;
20	aus 2-Amino-4,5-cyclopenteno-3-ethoxycarbonyl-thiophen 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
25	aus 2-Amino-4,5-cyclohepteno-3-ethoxycarbonyl-thiophen 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	aus 2-Amino-5-ethyl-3-ethoxycarbonyl-thiophen 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
30	aus 2-Amino-5-chlor-3-ethoxycarbonyl-thiophen 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
35	aus 2-Amino-4-chlor-5-methyl-3-ethoxycarbonyl-thiophen 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	aus 2-Amino-5-nitro-3-ethoxycarbonyl-thiophen

10

15

20

25

30

35

4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
aus 2-Amino-4,5-dimethyl-3-ethoxycarbonyl-thiophen
4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
aus 2-Amino-5-trifluormethyl-3-ethoxycarbonyl-thiophen
4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin.
Analog erhält man durch Umsetzung von 4-Cyanpyridin und
anschließender Reaktion mit POCI ₃
aus 2-Amino-5-methyl-3-ethoxycarbonyl-thiophen
4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
aus 2-Amino-4-methyl-3-ethoxycarbonyl-thiophen
4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
aus 2-Amino-4,5,6,7-tetrahydro-3-ethoxycarbonyl-benzothiophen
4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d] pyrimidin;
aus 2-Amino-4,5-cyclopenteno-3-ethoxycarbonyl-thiophen
4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
aus 2-Amino-4,5-cyclohepteno-3-ethoxycarbonyl-thiophen
4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

aus 2-Amino-5-ethyl-3-ethoxycarbonyl-thiophen

4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

aus 2-Amino-5-chlor-3-ethoxycarbonyl-thiophen
4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

aus 2-Amino-4-chlor-5-methyl-3-ethoxycarbonyl-thiophen 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

aus 2-Amino-5-nitro-3-ethoxycarbonyl-thiophen 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin; aus 2-Amino-4,5-dimethyl-3-ethoxycarbonyl-thiophen 5 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin; aus 2-Amino-5-trifluormethyl-3-ethoxycarbonyl-thiophen 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin. 10 Beispiel 4 Analog Beispiel 1 erhält man durch Umsetzung von 3,4-Methylendioxybenzylamin 15 mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin; mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 20 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin; mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]pyrimidin 25 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin, F. 215°; mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-5,6-cyclopenteno-30 thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

35

mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-5,6-cyclohepteno-

10

15

20

30

35

2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-6-methyl-thieno-25 [2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]pyrimidin

2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)- 5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;

- mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 5 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-6-ethyl-thieno[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-6-chlor-thieno[2,3-d]-pyrimidin;
 - mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
 - mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 25 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(lsoxazol-5-yl)-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

20

35

- mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
 - mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

25

- 65 -

mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin	
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-5-methyl-thien	10-
[2,3-d]-pyrimidin;	

- mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin

 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
 - mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
 - mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
 - mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-6-nitro-thieno[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

	2-(Pyrazin-2-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin.
5	• • • • • • • • • • • • • • • • • • • •
	mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
10	mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
15	mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin
	2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-5,6,7,8-tetrahydro [1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20	mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
25	mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
30	mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
35	mit 4-Chlor-2-(nyridin-2-yl)-5-chlor-6-methyl-thiano [2,3,d] pyrimidin

15

- 67 -

2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

- mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
 2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-5,6-dimethylthieno-[2,3-d]-pyrimidin;
 - mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
 - mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 20 mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]pyrimidin
 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-
 - 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin, F. 185°;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

	mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-6-ethyl-thieno- [2,3-d]-pyrimidin;
5	mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
10	mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
15	mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20	mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin.
25	Analog erhält man durch Umsetzung von 3-Chlor-4-methoxy-benzylamin
30	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-

35

pyrimidin

15

30

35

2-(Pyridin-3-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-5,6,7,8-tetra-hydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;

- mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-5,6-cycloheptenothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
 - mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
 - mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 20 mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
 - mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
 - mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
 - mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

WO 98/06722 PCT/EP97/04139 - 70 -

2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-6-methyl-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;	•

mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-5-methyl-thieno[2,3-d]-pyrimidin;

5

15

20

- mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin
- 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-5,6,7,8-tetra-hydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
 - mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
 - mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
 - mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-6-chlor-thieno[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-6-nitro-thieno[2,3-d]-pyrimidin;

WO 98/06722 - 71 -

mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-5,6-dimethylthieno-[2,3-d]-pyrimidin; 5 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-6-trifluormethylthieno-[2,3-d]-pyrimidin; mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 10 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin; mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-5-methyl-thieno-15 [2,3-d]-pyrimidin; mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-5,6,7,8-tetra-20 hydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin; mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-5,6-cyclopentenothieno-[2,3-d]-pyrimidin; 25 mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-5,6-cycloheptenothieno-[2,3-d]-pyrimidin; 30 mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin; mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 35 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

5	mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
10	mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
15	mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20	mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
25	mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
30	mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
35	mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

5

15

35

2-(Pyridin-2-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-5,6-cycloheptenothieno-[2,3-d]-pyrimidin;

- mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
 2-(Pyridin-2-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
 - mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
 - mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 20 mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
 2-(Pyridin-2-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin.
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-6-methyl-thieno[2,3-d]-pyrimidin;
 - mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

- 74 -

mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin

2-(Pyridin-4-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;

5

- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
 - mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
 - mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

25

20

- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin.

	Analog erhält man durch Umsetzung von 3,4-Dimethoxy-benzylamin
5	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
10	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin
15	2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-5,6,7,8-tetra-hydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
25	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
30	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-5-chlor-6-methyl-
35	thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

WO 98/06722 - 76 -

	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
	2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
5	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
10	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
15	mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20	mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(lsoxazol-5-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-
25	[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
30	mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
35	mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-

pyrimidin;

	mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
5	
	mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
10	mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
15	mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20	mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
25	mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20	mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
30	mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
35	mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

PCT/EP97/04139 WO 98/06722

> 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-5,6-cyclopentenothieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-5,6-cycloheptenothieno-[2,3-d]-pyrimidin;

5

10

15

30

35

- mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-6-chlor-thieno-[2,3-d]pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-5-chlor-6-methylthieno-[2,3-d]-pyrimidin;

- 20 mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-6-nitro-thieno-[2,3-d]pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 25 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
 - mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-6-trifluormethylthieno-[2,3-d]-pyrimidin;
 - mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-6-methyl-thieno-[2,3d]-pyrimidin;
 - mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

15

20

- 79 -

2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-5-methyl-thieno-[2,3d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-5 pyrimidin

2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;

- mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 10 2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-5,6-cyclopentenothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
 - mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-5,6-cycloheptenothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
 - mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-6-chlor-thieno-[2,3-d]pyrimidin;

- 25 mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-5-chlor-6-methylthieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 30 2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-6-nitro-thieno-[2,3-d]pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-5,6-dimethyl-thieno-35 [2,3-d]-pyrimidin;

	mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin.
5	mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
10	mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin
15	2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-[1] benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20	mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
25	mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
30	mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
35	mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-5-chlor-6-methyl-

thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

	mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-6-nitro-thieno-[2,3-d]- pyrimidin;
5	pyriman,
	mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
10	mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin.
15	Analog erhält man durch Umsetzung von Benzylamin
13	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-benzylamino-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-benzylamino-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin
25	2-(Pyridin-3-yl)-4-benzylamino-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin, F. 189°;
	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-benzylamino-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
30	
	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-benzylamino-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
35	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-benzylamino-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin:

	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-benzylamino-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
5	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-benzylamino-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
10	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-benzylamino-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-benzylamino-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
15	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-benzylamino-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20	mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(lsoxazol-5-yl)-4-benzylamino-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Isoxazol-5-yl)-4-benzylamino-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
25	mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(lsoxazol-5-yl)-4-benzylamino-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno- [2,3-d]-pyrimidin;
30	mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Isoxazol-5-yl)-4-benzylamino-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
35	mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(lsoxazol-5-yl)-4-benzylamino-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

- mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Isoxazol-5-yl)-4-benzylamino-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Isoxazol-5-yl)-4-benzylamino-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(lsoxazol-5-yl)-4-benzylamino-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin:
- mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(lsoxazol-5-yl)-4-benzylamino-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5.6-dimethyl-thieno-[2.3-d]-pyrimidin 2-(lsoxazol-5-yl)-4-benzylamino-5.6-dimethyl-thieno-[2.3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2.3-d]-pyrimidin 2-(Isoxazol-5-yl)-4-benzylamino-6-trifluormethyl-thieno-[2.3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-methyl-thieno-[2.3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-benzylamino-6-methyl-thieno-[2.3-d]-pyrimidin:
- mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5-methyl-thieno-[2.3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-benzylamino-5-methyl-thieno-[2.3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6,7.8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin
 - 2-(Pyrazin-2-yl)-4-benzylamino-5.6.7.8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5.6-cyclopenteno-thieno-[2.3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-benzylamino-5.6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-benzylamino-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]pyrimidin; 5 mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-benzylamino-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin; mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-benzylamino-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin; 10 mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-benzylamino-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]pyrimidin; 15 mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-benzylamino-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin; mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-benzylamino-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin; 20 mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-benzylamino-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]pyrimidin; 25 mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-benzylamino-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin; mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-benzylamino-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin; 30 mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-benzylamino-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin; 35

mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

	2-(Pyridin-2-yl)-4-benzylamino-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]- pyrimidin;
5	mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-benzylamino-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
10	mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-benzylamino-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-benzylamino-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
15	mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-benzylamino-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20	mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-benzylamino-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-benzylamino-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
25	mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-benzylamino-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
30	mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-benzylamino-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-benzylamino-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
35	mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin

5

10

20

30

2-(Pyridin-4-yl)-4-benzylamino-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;

- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-benzylamino-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-benzylamino-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
 - mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-benzylamino-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-benzylamino-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
 - mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-benzylamino-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
 - mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-benzylamino-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin:
- 25 mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-benzylamino-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
 - mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-benzylamino-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin.

Analog erhält man durch Umsetzung von 4-Fluorbenzylamin

mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

2-(Pyridin-3-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-6-methyl-thieno-[2,3-d]pyrimidin;

	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-5-methyl-thieno-[2,3-d]- pyrimidin;
5	py
	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin
	2-(Pyridin-3-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
10	
	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
15	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
25	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
30	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
35	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

WO 98/06722 PCT/EP97/04139

5	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
J	mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
10	mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
15	mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin
	2-(Isoxazol-5-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20	mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
25	mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
30	mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
35	mit 4-Chlor-2-/isoxazol-5-vl\-5-chlor-6-methyl-thjeno-[2 3-d]-pyrimidin

- 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin
 - 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-5,6,7.8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2.3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2.3-d]-pyrimidin;

	mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]- pyrimidin;
5	mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
10	mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
15	mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20	mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20	mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
25	mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
30	mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin
35	2-(Pyridin-2-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;

r	mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
5	mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
10	mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
15	mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20	mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
25	mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
30	mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
35	mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin
 - 2-(Pyridin-4-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2.3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

WO 98/06722

- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin.
- 5 Analog erhält man durch Umsetzung von 3,4-Dichlorbenzylamin

mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

10

- mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin

2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;

- 20 mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-5,6-cyclohepteno-thieno[2,3-d]-pyrimidin;
 - mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
 - mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

35

30

mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

- 94 -

	2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
5	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
10	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
15	mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-6-methyl-thieno-[2,3-d]- pyrimidin;
20	mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
25	mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
30	mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-5,6-cyclopenteno-thieno [2,3-d]-pyrimidin;
35	mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-5,6-cyclohepteno-thieno [2,3-d]-pyrimidin;

WO 98/06722

20

mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;

- 5 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
 2-(lsoxazol-5-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-6-chlor-thieno-[2,3-d]pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-5-chlor-6-methyl-thieno[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-6-nitro-thieno-[2,3-d]pyrimidin;
 - mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
 - mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(lsoxazol-5-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 25 mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-6-methyl-thieno-[2,3-d]pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-5-methyl-thieno-[2,3-d]pyrimidin;
 - mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin
- 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;

WO 98/06722 PCT/EP97/04139

	mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-5,6-cyclopenteno-thieno [2,3-d]-pyrimidin;
5	mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-5,6-cyclohepteno-thieno [2,3-d]-pyrimidin;
10	mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
15	mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20	mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
25	mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
25	mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
30	mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
35	mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-6-methyl-thieno-[2,3-d]- pyrimidin;

	mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-5-methyl-thieno-[2,3-d] pyrimidin;
5	
	mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin
	2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
10	
	mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-5,6-cyclopenteno-thien [2,3-d]-pyrimidin;
15	mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-5,6-cyclohepteno-thieno [2,3-d]-pyrimidin;
20	mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
25	mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
30	mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
30	mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
	2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
35	mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

	2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
5	mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
10	mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
15 20	mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20	mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
25	mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
30	mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
35	mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

PCT/EP97/04139

	mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
5	mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
10	mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3 d]-pyrimidin;
15	mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin.
	Analog erhält man durch Umsetzung von 3-Nitrobenzylamin
20	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
25	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
30	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
35	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3 d]-pyrimidin;
~~	

mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

- 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3-nitrobenzylamıno)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2.3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-methyl-thieno-[2.3-d]-pyrimidin 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5-methyl-thieno-[2.3-d]-pyrimidin 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin

2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

5

10

15

25

30

35

mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(lsoxazol-5-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

20 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(isoxazol-5-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

WO 98/06722 PCT/EP97/04139

	2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-6-methyl-thieno-[2,3-d]- pyrimidin;
5	mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin
10	2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
15	mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3 d]-pyrimidin;
20	mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3 d]-pyrimidin;
	mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
25	mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
30	mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-
35	pyrimidin;

- 103 -

mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]pyrimidin; 5 mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]pyrimidin; mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 10 2-(Pyridin-2-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-6-methyl-thieno-[2,3-d]pyrimidin; mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-15 pyrimidin; mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-20 benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin; mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3d]-pyrimidin; 25 mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3d]-pyrimidin; 30 mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]pyrimidin; mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 35 2-(Pyridin-2-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-6-chlor-thieno-[2,3-d]pyrimidin;

	mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
5	mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
10	mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
15	mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20	mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
25	mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
30	mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
35	mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

PCT/EP97/04139

mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

5

mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

20

- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin.
- 25 Analog erhält man durch Umsetzung von 3,4-Methylendioxyphenethylamin
 - mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

30

- mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin

thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

35

	2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
5	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
10	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
15	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
25	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
30	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-6-trifluormethyl-

mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

15

20

- 107 -

2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-6-methylthieno-[2,3-d]-pyrimidin;

- mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-5-methylthieno-[2,3-d]-pyrimidin;
 - mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin
- 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-5,6,7,8-tetra-hydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
 - mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(lsoxazol-5-yl)-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
 - mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
 - mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(lsoxazol-5-yl)-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 25 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-5-chlor-6methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-6-nitro-thieno[2,3-d]-pyrimidin;

[2,3-d]-pyrimidin;

[2,3-d]-pyrimidin;

5

35

	anit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-5,6-dimethyl- thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
5	mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
	2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
10	2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
	2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-5-methyl-
15	thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin
	2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-5,6,7,8-tetra-
20	hydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
	2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-5,6-cyclo-
	penteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
25	
	mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
	2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-5,6-
	cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
30	mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-6-ethyl-thieno-

2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-6-chlor-thieno-

mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

- 109 -

	mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
	2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-5-chlor-6-
	methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
5	
	mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
	2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-6-nitro-thieno-
	[2,3-d]-pyrimidin;
	[2,0 d] pyrimani,
10	mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
	2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-5,6-dimethyl-
	thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
15	
10	2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-6-
	trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
	2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-6-methyl-
20	thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20	tineno-[2,3-dj-pyrimain,
	mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
	2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-5-methyl-
	thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
25	anono (2,0 d) pyrmani,
	mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-
	pyrimidin
	2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-5,6,7,8-tetra-
30	hydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	mit 4 Chlor 2 (puridin 2 vl) 5.6 avalanantana thiana (2.2 dl murimidia
	mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
	2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-5,6-cyclo-
	penteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
35	mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
	init 4-0mor-2-(pynom-2-yn-0,0-cyclottepteno-tilleno-[2,3-d]-pynmidin

15

2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

- mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
 2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-6-chlor-thieno[2,3-d]-pyrimidin;
 - mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
 - mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 20 mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
 2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-6-methylthieno-[2,3-d]-pyrimidin;
 - mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

	mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin
5	2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-5,6,7,8-tetra-hydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
5	mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
10	mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
15	mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20	mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
25	mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
25	mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
30	mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
35	mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-6-trifluormethyl-

thieno-[2,3-d]-pyrimidin.

	Analog erhält man durch Umsetzung von 3,4-Ethylendioxybenzylamin
5	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
10	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin
15	2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-5,6,7,8-tetrahydro [1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
25	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3 d]-pyrimidin;
30	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-6-chlor-thieno-[2,3 d]-pyrimidin;
	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-5-chlor-6-methyl-
35	thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

d]-pyrimidin;

- 113 -

	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
5	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
10	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
15	mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20	mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20	mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-
25	[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
30	mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
35	mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3-

5	mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
10	mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
15	mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20	mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
25	mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
23	mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
30	mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-5,6,7,8-tetrahydro- [1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

	2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
5	mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3-
10	d]-pyrimidin;
	mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
15	aj-pyrimain,
	mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20	mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
25	2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-5,6-dimethyl-thieno-

mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

[2,3-d]-pyrimidin;

30

20

WO 98/06722 PCT/EP97/04139

> 2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-5 pyrimidin

> 2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;

- mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 10 2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-5,6-cyclopentenothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
 - mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-5,6-cycloheptenothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
 - mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-6-chlor-thieno-[2,3d]-pyrimidin;

- 25 mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-5-chlor-6-methylthieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 30 2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-6-nitro-thieno-[2,3d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-5,6-dimethyl-thieno-35 [2,3-d]-pyrimidin;

25

- 117 -

mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-6-trifluormethyl
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

- 5 mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-5-methyl-thieno[2,3-d]-pyrimidin;
 - mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin
- 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
 - mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
 - mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
 - mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

	•
5	mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
10	mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin.
15	Analog erhält man durch Umsetzung von Phenethylamin
10	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-phenethylamino-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-phenethylamino-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin
25	2-(Pyridin-3-yl)-4-phenethylamino-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-phenethylamino-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
30	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-phenethylamino-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
35	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-3-yl)-4-phenethylamino-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

WO 98/06722 PCT/EP97/04139 - 119 -

	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
	2-(Pyridin-3-yl)-4-phenethylamino-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
5	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
	2-(Pyridin-3-yl)-4-phenethylamino-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
10	2-(Pyridin-3-yl)-4-phenethylamino-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
45	2-(Pyridin-3-yl)-4-phenethylamino-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
15	mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
	2-(Pyridin-3-yl)-4-phenethylamino-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]- pyrimidin;
20	mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
	2-(Isoxazol-5-yl)-4-phenethylamino-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
25	2-(Isoxazol-5-yl)-4-phenethylamino-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin
	2-(Isoxazol-5-yl)-4-phenethylamino-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
30	benzouneno-[2,5-aj-pyrimiant,
	mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Isoxazol-5-yl)-4-phenethylamino-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
35	mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

	2-(Isoxazol-5-yl)-4-phenethylamino-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
5	mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Isoxazol-5-yl)-4-phenethylamino-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Isoxazol-5-yl)-4-phenethylamino-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
10	mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Isoxazol-5-yl)-4-phenethylamino-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
15	mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Isoxazol-5-yl)-4-phenethylamino-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20	mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Isoxazol-5-yl)-4-phenethylamino-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20	mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Isoxazol-5-yl)-4-phenethylamino-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
25	mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-phenethylamino-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
30	mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-phenethylamino-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-phenethylamino-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-
35	benzothieno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chle	or-2-(pyrazin-2-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(P	yrazin-2-yl)-4-phenethylamino-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]
pyrii	midin;

- 5 mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-phenethylamino-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

 2-(Pyrazin-2-yl)-4-phenethylamino-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
 - mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-phenethylamino-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-phenethylamino-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

 2-(Pyrazin-2-yl)-4-phenethylamino-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
 - mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-phenethylamino-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

25

- mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyrazin-2-yl)-4-phenethylamino-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-phenethylamino-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
 - mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-phenethylamino-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

	mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin
5	2-(Pyridin-2-yl)-4-phenethylamino-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-phenethylamino-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
10	mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-phenethylamino-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
15	mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-phenethylamino-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-phenethylamino-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20	mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-phenethylamino-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
2 5	mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-phenethylamino-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
	mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-phenethylamino-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
30	mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-2-yl)-4-phenethylamino-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

2-(Pyridin-4-yl)-4-phenethylamino-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-phenethylamino-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin

2-(Pyridin-4-yl)-4-phenethylamino-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;

10

20

mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-phenethylamino-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-phenethylamino-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-phenethylamino-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
 - mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-phenethylamino-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 25 mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-phenethylamino-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
 - mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-phenethylamino-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
 - mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin 2-(Pyridin-4-yl)-4-phenethylamino-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

35

30

mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

2-(Pyridin-4-yl)-4-phenethylamino-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin.

Beispiel 5

5

10

Eine Lösung von 2-(Imidazol-1-yl)-6-methyl-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin in Methanol wird in Gegenwart von Raney-Nickel hydriert. Der Katalysator wird abfiltriert und die Lösung eingeengt. Man erhält nach Umkristallisation 2-(Imidazol-1-yl)-6-methyl-4-(3-aminobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin.

Beispiel 6

Eine Lösung von 6 g 2-(Imidazol-1-yl)-6-methyl-4-(3-amino-benzylamino)thieno-[2,3-d]-pyrimidin und 0,5 g Titantetrachlorid in 100 ml Methanol wird
mit 1 ml frisch destilliertem Acetaldehyd versetzt. Anschließend gibt man 4
g Natriumcyanborhydrid dazu und rührt 30 Stunden. Man gibt halbkonzentrierte Salzsäure dazu, arbeitet wie üblich auf und erhält 2(Imidazol-1-yl)-6-methyl-4-(3-N-ethylamino-benzylamino)-thieno-[2,3-dpyrimidin.

Beispiel 7

Analog Beispiel 2 erhält man die nachstehenden Verbindungen

25

2-(Imidazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3,4-difluorbenzylamino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin, F. 212°;

- 2-(Imidazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-30 pyrimidin, F. 221°;
 - 2-(Imidazol-1-yl)-6-methyl-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin, F. 241°:
- 2-(Imidazol-1-yl)-6-methyl-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin, F. 217°;

	2-(Imidazol-1-yl)-6-chlor-5-methyl-4-(3,4-methylendioxybenzylamino) thieno-[2,3-d]-pyrimidin, F. 250°;
5	2-(Imidazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-benzylamino[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin, F. 190°;
10	2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-methyl-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin, F. 231°;
10	2-(Imidazol-1-yl)-6-isopropyl-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin, F. 192°;
15	2-(Imidazol-1-yl)-6-propyl-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin, F. 183°.
20	

30

- 126 -

Die nachfolgenden Beispiele betreffen pharmazeutische Zubereitungen:

Beispiel A: Injektionsgläser

5

10

15

Eine Lösung von 100 g eines Wirkstoffes der Formel I und 5 g Dinatriumhydrogenphosphat wird in 3 I zweifach destilliertem Wasser mit 2 n Salzsäure auf pH 6,5 eingestellt, steril filtriert, in Injektionsgläser abgefüllt, unter sterilen Bedingungen lyophilisiert und steril verschlossen. Jedes Injektionsglas enthält 5 mg Wirkstoff.

Beispiel B: Suppositorien

Man schmilzt ein Gemisch von 20 g eines Wirkstoffes der Formel I mit 100 g Sojalecithin und 1400 g Kakaobutter, gießt in Formen und läßt erkalten. Jedes Suppositorium enthält 20 mg Wirkstoff.

Beispiel C: Lösung

Man bereitet eine Lösung aus 1 g eines Wirkstoffes der Formel I, 9,38 g NaH₂PO₄ · 2 H₂O, 28,48 g Na₂HPO₄ · 12 H₂O und 0,1 g Benzalkonium-chlorid in 940 ml zweifach destilliertem Wasser. Man stellt auf pH 6,8 ein, füllt auf 1 I auf und sterilisiert durch Bestrahlung. Diese Lösung kann in Form von Augentropfen verwendet werden.

25

Beispiel D: Salbe

Man mischt 500 mg eines Wirkstoffes der Formel I mit 99,5 g Vaseline unter aseptischen Bedingungen.

30

35

Beispiel E: Tabletten

Ein Gemisch von 1 kg Wirkstoff der Formel I, 4 kg Lactose, 1,2 kg Kartoffelstärke, 0,2 kg Talk und 0,1 kg Magnesiumstearat wird in üblicher Weise zu Tabletten verpreßt, derart, daß jede Tablette 10 mg Wirkstoff enthält.

- 127 -

Beispiel F: Dragees

Analog Beispiel E werden Tabletten gepreßt, die anschließend in üblicher Weise mit einem Überzug aus Saccharose, Kartoffelstärke, Talk, Tragant und Farbstoff überzogen werden.

Beispiel G: Kapseln

2 kg Wirkstoff der Formel I werden in üblicher Weise in Hartgelatinekapseln gefüllt, so daß jede Kapsel 20 mg des Wirkstoffs enthält.

Beispiel H: Ampullen

15 Eine Lösung von 1 kg Wirkstoff der Formel I in 60 I zweifach destilliertem Wasser wird steril filtriert, in Ampullen abgefüllt, unter sterilen Bedingungen lyophilisiert und steril verschlossen. Jede Ampulle enthält 10 mg Wirkstoff.

20 Beispiel I: Inhalations-Spray

Man löst 14 g Wirkstoff der Formel I in 10 I isotonischer NaCI-Lösung und füllt die Lösung in handelsübliche Sprühgefäße mit Pump-Mechanismus. Die Lösung kann in Mund oder Nase gesprüht werden. Ein Sprühstoß (etwa 0,1 ml) entspricht einer Dosis von etwa 0,14 mg.

Patentansprüche

1. Verbindungen der Formel I

5 1 10 worin R^1 , R^2 jeweils unabhängig voneinander H, A, OA, Alkenyl, Alkinyl, NO₂, CF₃ oder Hal, 15 wobei einer der Reste R¹ oder R² immer ≠ H ist. R¹ und R² zusammen auch Alkylen mit 3-5 C-Atomen, R^3 , R^4 jeweils unabhängig voneinander H, A, OA, Hal, NO2, 20 NH₂, NHA oder NAA', R³ und R⁴ zusammen auch -O-CH2-CH2-, -O-CH2-O- oder -O-CH2-CH2-O-, 25 A, A' jeweils unabhängig voneinander Alkyl mit 1 bis 6 C-Atomen, X einen unsubstituierten oder ein-, zwei- oder dreifach durch A, Hal oder CF₃ substituierten ungesättigten 5-7-30 gliedrigen Heterocyclus mit 1-4 N, O- und/oder S-Atomen, worin zusätzlich weitere CH2-Gruppen durch NH, NA, S oder O ersetzt sein können, über N oder C gebunden, 35 Hal F, Cl, Br oder I

und

n 0, 1, 2 oder 3

5

20

bedeuten.

sowie deren physiologisch unbedenklichen Salze.

- 10 2. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1
 - (a) 2-(1-lmidazolyl)-6-methyl-4-(3,4-methylendioxy-benzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- (b) 2-(1-Imidazolyl)-5,6-dimethyl-4-(3,4-methylendioxy-benzyl-amino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
 - (c) 2-(1-lmidazolyl)-4-(3,4-methylendioxy-benzylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
 - (d) 2-(1-lmidazolyl)-5-chlor-4-(3,4-methylendioxy-benzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- (e) 2-(1-lmidazolyl)-6-chlor-4-(3,4-methylendioxy-benzylamino)thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
 - (f) 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-4-(3,4-methylendioxy-benzylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 30 (g) 2-(Pyrazol-1-yl)-4-(3,4-methylendioxy-benzylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
 - (h) 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-methylendioxy-benzylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin.

3. Verfahren zur Herstellung

 a) von Verbindungen der Formel I nach Anspruch 1 sowie deren Salzen, worin X über N gebunden ist,

dadurch gekennzeichnet, daß man eine Verbindung der Formel II

$$R^{2} \xrightarrow{\text{HN}} (CH_{2})_{n} \xrightarrow{\mathbb{R}^{4}} \mathbb{R}^{3}$$

15 worin

5

10

20

25

30

35

R¹, R², R³, R⁴ und n die angegebenen Bedeutungen haben,

und L CI, Br, OH, SCH₃ oder eine reaktionsfähige veresterte OH-Gruppe bedeutet,

mit einem unsubstituierten oder ein-, zwei- oder dreifach durch A, Hal oder CF₃ substituierten ungesättigten 5-7-gliedrigen Heterocyclus mit mindestens einer NH-Gruppe, worin zusätzlich weitere CH₂-Gruppen durch NH, NA, S oder O ersetzt sein können,

umsetzt,

oder

b) von Verbindungen der Formel I nach Anspruch 1 sowie deren Salzen, worin X über C gebunden ist,

dadurch gekennzeichnet, daß man eine Verbindung der Formel III

WO 98/06722 - 131 -

$$R^{1}$$
 S
 N
 X

PCT/EP97/04139

worin

5

20

30

35

R¹, R² und X die angegebenen Bedeutungen haben,

und L Cl, Br, OH, SCH₃ oder eine reaktionsfähige veresterte OH-Gruppe bedeutet,

mit einer Verbindung der Formel IV

$$H_2N \xrightarrow{(CH_2)_n} R^3$$

worin

R³, R⁴ und n die angegebenen Bedeutungen haben,

umsetzt,

25 oder

c) daß man in einer Verbindung der Formel I einen Rest R¹, R², R³ und/oder R⁴ in einen anderen Rest R¹, R², R³ und/oder R⁴ umwandelt, indem man eine Nitrogruppe reduziert, eine primäre oder eine sekundäre Aminogruppe durch reduktive Aminierung in ein alkyliertes Amin umwandelt oder acyliert,

und/oder daß man eine basische Verbindung der Formel I durch Behandeln mit einer Säure in eines ihrer Salze überführt.

10

- 4. Verfahren zur Herstellung pharmazeutischer Zubereitungen, dadurch gekennzeichnet, daß man eine Verbindung der Formel I nach Anspruch 1 und/oder eines ihrer physiologischen unbedenklichen Salze zusammen mit mindestens einem festen, flüssigen oder halbflüssigen Träger- oder Hilfsstoff in eine geeignete Dosierungsform bringt.
- 5. Pharmazeutische Zubereitung, gekennzeichnet durch einen Gehalt an mindestens einer Verbindung der Formel I nach Anspruch 1 und/oder einem ihrer physiologisch unbedenklichen Salze.
- 6. Verbindungen der Formel I nach Anspruch 1 und ihre physiologisch unbedenklichen Salze zur Bekämpfung von Krankheiten des Herz-Kreislaufsystems und zur Therapie von Potenzstörungen.
- 15 7. Arzneimittel der Formel I nach Anspruch 1 und ihre physiologisch unbedenklichen Salze als Phosphodiesterase V-Hemmer.
 - 8. Verwendung von Verbindungen der Formel I nach Anspruch 1 und/oder ihre physiologisch unbedenklichen Salze zur Herstellung eines Arzneimittels.
 - Verwendung von Verbindungen der Formel I nach Anspruch 1 und/oder ihrer physiologisch unbedenklichen Salze bei der Bekämpfung von Krankheiten.

30

25

20



inter

PCT/EP 97/04139

			
A. CLASS	FICATION OF SUBJECT MATTER C07D495/04 A61K31/505 //(C07D	495/04,333:00,239:00)	
According	o International Patent Classification(IPC) or to both national classific	ration and IPC	
Ť	SEARCHED	callott and if O	
	ocumentation searched (classification system followed by classification	tion symbols)	
IPC 6	C07D A61K		
Documenta	tion searched other than minimum documentation to the extent that	such documents are included in the fields se	arched
Electronic d	ata base consulted during the international search (name of data b	ase and, where practical, search terms used)
			
C. DOCUM	ENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		,
Category "	Citation of document, with indication, where appropriate, of the re	levant passages	Relevant to claim No.
Α	EP 0 579 496 A (ONO) 19 January		1,7
	see page 17, line 5 - page 18, l	ine 40;	
	claim 1		
P,X	EP 0 728 759 A (ONO) 28 August 1	996	1,5,7
,	see page 33, line 14 - page 34,		, , , ,
	claims 1,12; examples 1,2		
	-	 	
	ner documents are listed in the continuation of box C.	X Patent family members are listed in	n annex.
° Special ca	tegories of cited documents :	"T" later document published after the inte	
	nt defining the general state of the art which is not ered to be of particular relevance	or priority date and not in conflict with cited to understand the principle or the invention	
"E" earlier o	focument but published on or after the international	"X" document of particular relevance; the o	
"L" docume	nt which may throw doubts on priority claim(s) or	cannot be considered novel or cannot involve an inventive step when the do	
	is cited to establish the publicationdate of another i or other special reason (as specified)	"Y" document of particular relevance; the cannot be considered to involve an in-	
"O" docume other n	ent referring to an oral disclosure, use, exhibition or neans	document is combined with one or mo ments, such combination being obvior	ore other such docu-
	ont published prior to the international filling date but an the priority date claimed	in the art. "&" document member of the same patent	
	actual completion of theinternational search	Date of mailing of the international sea	
Daile of the c	strair competent of memerical oral search	Date of maining of the international sea	ich report
12	2 January 1998	20/01/1998	
Name and m	nailing address of the ISA European Patent Office, P.B. 5818 Patentiaan 2	Authorized officer	
	NL - 2280 HV Rijswijk		
	Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl. Fax: (+31-70) 340-3016	Alfaro Faus, I	•

INTI WATIONAL SEARCH REPORT

.nformation on patent family members

Into chel Application No PCT/EP 97/04139

Patent document cited in search rep		Publication date	Patent family member(s)		Publication date
EP 579496	A	19-01-94	CA 2100626 JP 2657760 JP 6192235 JP 8099962 US 5436233 US 5439895	B A A A	16-01-94 24-09-97 12-07-94 16-04-96 25-07-95 08-08-95
EP 728759	A	28-08-96	JP 8269060	A	15-10-96

nte onales Aktenzeichen PCT/EP 97/04139

A. KLASS IPK 6	ifizierung des anmeldungsgegenstandes C07D495/04 A61K31/505 //(C07[0495/04,333:00.239:00)	
Nach der Ir	nternationalen Patentiklassifikation (IPK) oder nach der nationalen K	lassifikation und der IPK	
B. RECHE	RCHIERTE GEBIETE		
Pecherchie IPK 6	ner Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssym C07D A61K	bole)	
	rte aber nicht zum Mindestprüfstoffgehorende Veröffentlichungen, i		
	er internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete	Suchbegreffe)
	SENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Anga	be der in Belracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
Α	EP 0 579 496 A (ONO) 19.Januar 1 siehe Seite 17, Zeile 5 - Seite 40; Anspruch 1		1,7
P, X	EP 0 728 759 A (ONO) 28.August 1 siehe Seite 33, Zeile 14 - Seite 24; Ansprüche 1,12; Beispiele 1,	34, Zeile	1,5,7
	ere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu ehmen	X Siehe Anhang Patentfamilie	
"A" Veröffen aber nu "E" älleres C Anmeld "L" Veröffent scheine anderet soll ode ausgeft "O" Veröffen eine Be "P" Veröffen	Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen tilichung, die den allgemeinen Stand der Technik delmiert, cht als besonders bedeutsam anzusehen ist lokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen ledatum veröffentlicht worden ist litichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweielhaft ernin zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer nim Recherchenbencht genannten Veröffentlichung belegt werden in die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie zint) tillchung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, mutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht tillchung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach anspruchten Priontätsdatum veröffentlicht worden ist	"T" Spätere Veröffentlichung, die nach demi oder dem Priontätsdatum veröffentlicht Anmeldung nicht kollidiert, sondem nur Erfindung zugrundeliegenden Prinzips of Theone angegeben ist "X" Veröffentlichung von besonderer Bedeut kann allein aufgrund dieser Veröffentlich erfinderischer Tätigkeit beruhend betrac "Y" Veröffentlichung von besonderer Bedeut kann nicht als auf erfindenscher Tätigke werden, wenn die Veröffentlichung mitse Veröffentlichungen dieser Kategone in vidlese Verbindung für einen Fachmann nur "&" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Fillen und veröffentlichung, die Mitglied derselben Fillen und veröffentlichung, die Mitglied derselben Fillen verschaften verschaft	worden ist und mit der zum Verständnis des der ider der ihr zugrundellegenden ung; die beanspruchte Erlindung iung nicht als neu oder auf intet werden ung; die beanspruchte Erlindung ib bruhend betrachtet iner oder mehreren anderen erbindung gebracht wird und lahellegend ist
Datum des A	bschlusses der internationalen Recherche	Absendedatum des internationalen Rec	herchenberichts
12	.Januar 1998	20/01/1998	
Name und Po	estanschrift der Internationalen Recherchenbehörde Europalisches Patentamt, P.B. 5818 Patentiaan 2 NL – 2280 HV Rijswijk	Bevollmächtigter Bediensteter	
	NL - 2200 HV HISWIJA Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl. Fax: (+31-70) 340-3016	Alfaro Faus, I	

Jeta:

Angaben zu Veroffentlichus J.n. die zur selben Patentlamilie gehören

Inter nates Aktenzeichen PCT/EP 97/04139

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument		Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentlamilie		Datum der Veröffentlichung
EP 579496	A	19-01-94	CA JP JP JP US	2100626 A 2657760 B 6192235 A 8099962 A 5436233 A 5439895 A	16-01-94 24-09-97 12-07-94 16-04-96 25-07-95 08-08-95
EP 728759	Α	28-08-96	JP	8269060 A	15-10-96